

①9 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑪ **DE 3535664 A1**

②① Aktenzeichen: P 35 35 664.2
②② Anmeldetag: 5. 10. 85
②③ Offenlegungstag: 9. 4. 87

⑤① Int. Cl. 4:
A01N 43/50
C 07 D 401/04
A 01 N 43/52

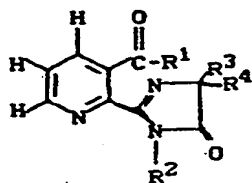
DE 3535664 A1

⑦① Anmelder:
Bayer AG, 5090 Leverkusen, DE

⑦② Erfinder:
Draber, Wilfried, Dr., 5600 Wuppertal, DE; Hänßler,
Gerd, Dipl.-Landw., Dr., 5090 Leverkusen, DE

⑤④ Fungizide Mittel auf Imidazolinylpyridin-Derivat-Basis

Fungizide Verwendung von bekannten Imidazolinyl-pyridinen der Formel



(I)

DE 3535664 A1

in welcher
R¹ für Hydroxy, Alkoxy oder für einen Rest -O·Me⁺ steht,
wobei
Me⁺ für ein Äquivalent eines Metallkations steht,
R² für Wasserstoff, Alkyl oder für ein Äquivalent eines Metallkations steht und
R³ und R⁴ unabhängig voneinander jeweils für Alkyl, Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl stehen oder
R³ und R⁴ gemeinsam für einen zweifach verknüpften Alkandiyrest stehen.

BEST AVAILABLE COPY

Patentansprüche

1. Verwendung von Imidazoliny-pyridinen der Formel (I)



in welcher

R¹ für Hydroxy, Alkoxy oder für einen Rest $-\text{O}^\oplus\text{Me}^\oplus$ steht, wobei

Me[⊕] für ein Äquivalent eines Metallkations steht,

R² für Wasserstoff, Alkyl oder für ein Äquivalent eines Metallkations steht und

R³ und R⁴ unabhängig voneinander jeweils für Alkyl, Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl stehen oder

R³ und R⁴ gemeinsam für einen zweifach verknüpften Alkandiyrest stehen,

als Fungizide.

2. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, worin in der Formel (I)

R¹ für Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für einen Rest

$-\text{O}^\oplus\text{Me}^\oplus$ steht, worin

Me[⊕] für ein Äquivalent eines Alkali- oder Erdalkalimetallkations steht,

R² für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für ein Äquivalent eines Alkali- oder Erdalkalimetallkations steht,

R³ und R⁴ unabhängig voneinander jeweils für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder für ein im Alkylteil geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkylalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil stehen oder

R³ und R⁴ gemeinsam für einen zweifach verknüpften Alkandiyrest mit 4 bis 6 Kohlenstoffatomen stehen, als Fungizide.

3. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, worin in der Formel (I)

R¹ für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy oder für einen Rest $-\text{O}^\oplus\text{Me}^\oplus$ steht, wobei Me[⊕] für ein Äquivalent eines Natrium-, Kalium- oder Calciumions steht,

R² für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, für ein Natrium- oder ein Kaliumion steht,

R³ und R⁴ unabhängig voneinander jeweils für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl stehen oder

R³ und R⁴ gemeinsam für 1,4-Butandiy, 1,5-Pentandiy oder 1,6-Hexandiy stehen,

als Fungizide.

4. Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man Imidazoliny-pyridine der Formel (I) auf Pilze und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

Beschreibung

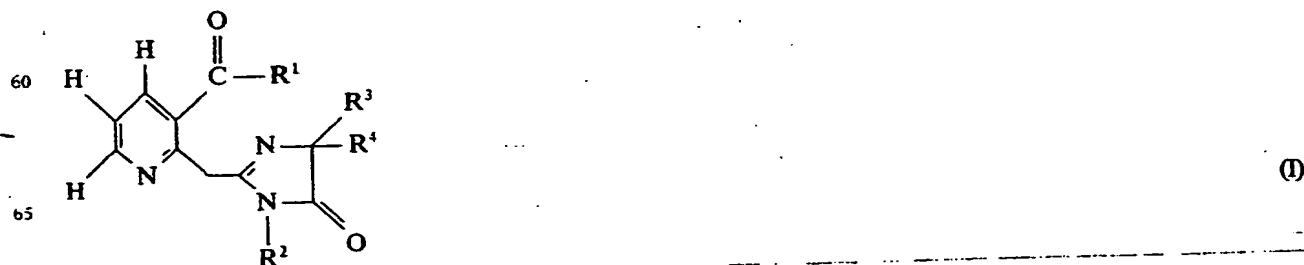
Die Erfindung betrifft die Verwendung von bekannten Imidazoliny-pyridinen als Fungizide.

Bestimmte Imidazoliny-pyridine und deren Verwendung als Herbizide sind bereits bekannt (vgl. z. B. EP 41 623).

Weiterhin ist bekannt, daß organische Schwefelverbindungen, wie beispielsweise das Zink-ethylen-1,2-bis-(dithiocarbamat) fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z. B. K. H. Büchel "Pflanzenschutz und Schädlingsbekämpfung" S. 137; G. Thieme Verlag Stuttgart 1977).

Die Wirksamkeit dieser vorbekannten Schwefelverbindungen ist jedoch, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und Konzentrationen nicht immer in allen Anwendungsgebieten völlig zufriedenstellend.

Es wurde nun gefunden, daß die bekannten Imidazoliny-pyridine der allgemeinen Formel (I),



in welcher

R^1 für Hydroxy, Alkoxy oder für einen Rest $-O^{\oplus}Me^{\oplus}$ steht, wobei

Me^{\oplus} für ein Äquivalent eines Metallkations steht,

R^2 für Wasserstoff, Alkyl oder für ein Äquivalent eines Metallkations steht und

R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Alkyl, Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl stehen oder

R^3 und R^4 gemeinsam für einen zweifach verknüpften Alkandiylrest stehen,

zur Verwendung als Fungizide geeignet sind.

Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäß verwendbaren Imidazoliny-pyridine der allgemeinen Formel (I) eine erheblich höhere fungizide Wirksamkeit, als die aus dem Stand der Technik bekannten organischen Schwefelverbindungen, wie beispielsweise das Zink-ethylen-1,2-bis-(dithiocarbamat), welches eine wirkungsmä-

Big naheliegende Verbindung ist.

Die erfindungsgemäß verwendbaren Imidazoliny-pyridine sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen

R^1 für Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in dem Alkoxyteil oder für einen Rest $-O^{\oplus}Me^{\oplus}$ steht, wobei

Me^{\oplus} für ein Äquivalent eines Alkali- oder Erdalkalimetallkations steht,

R^2 für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für ein Äquivalent eines Alkali- oder Erdalkalimetallkations steht und

R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder für ein im Alkylteil geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkylalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil stehen oder

R^3 und R^4 gemeinsam für einen zweifach verknüpften Alkandiylrest mit 4 bis 6 Kohlenstoffatomen stehen.

Besonders bevorzugt sind Imidazoliny-pyridine der Formel (I) bei welchen

R^1 für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy oder für einen Rest $-O^{\oplus}Me^{\oplus}$ steht, wobei

Me^{\oplus} für ein Äquivalent eines Natrium-, Kalium- oder Calciumions steht,

R^2 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, für ein Natrium- oder ein Kaliumion steht und

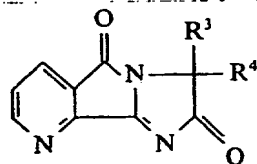
R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl stehen oder

R^3 und R^4 gemeinsam für 1,4-Butandiyl, 1,5-Pentandiyl oder 1,6-Hexandiyl stehen.

Im einzelnen seien die bei den Herstellungsbeispielen beschriebenen Verbindungen genannt.

Die erfindungsgemäß verwendbaren Imidazoliny-pyridine sind bekannt (vgl. z. B. EP 41 623) und können nach bekannten Verfahren hergestellt werden.

Man erhält sie z. B., wenn man Imidazo-pyrrolo-pyridine der Formel (II),



(II)

in welcher

R^3 und R^4 die oben angegebene Bedeutung haben, mit Alkoholen der Formel (III)

R^1-H

(III)

in welcher

R^1 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines basischen Katalysators, wie beispielsweise Natriumhydrid oder Diazabicycloundecen (DBU), bei Temperaturen zwischen 20°C und 150°C umgesetzt (vgl. EP 41 623), und gegebenenfalls anschließend nach üblichen Verfahren mit Alkylierungsmitteln der Formel (IV)

R^2-X

(IV)

in welcher

R^2' für Alkyl steht und

X für eine Abgangsgruppe wie beispielsweise Halogen (insbesondere Brom oder Iod) oder gegebenenfalls substituiertes Alkoxysulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy (insbesondere Methoxysulfonyloxy oder p-Toluolsulfonyloxy) steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Acetonitril oder Methanol, und

gegebenenfalls in Gegenwart eines basischen Katalysators, wie beispielsweise Natriummethylat, bei Temperaturen zwischen 20°C und 100°C alkyliert oder nach üblichen Methoden beispielsweise mit Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhydroxid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Methanol, bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C ein Salz bildet.

Die Imidazoliny-pyridine der Formel (Ia), bei welchen R^2 für Wasserstoff steht, liegen im tautomeren Gleich-

gewicht mit den entsprechenden 4-Oxoverbindungen der Formel (Ib) vor:



Beide tautomeren Strukturen der Formel (I) sind erfindungsgemäß verwendbar.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind bekannt (vgl. z. B. EP 41 623). Die Ausgangsstoffe der Formeln (III) und (IV) sind allgemein bekannte Verbindungen der organischen Chemie.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, vor allem als Fungizide, praktisch eingesetzt werden. Die Wirkstoffe sind für den Gebrauch als Pflanzenschutzmittel geeignet.

Fungizide Mittel im Pflanzenschutz werden eingesetzt zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

Bakterizide Mittel werden im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae eingesetzt.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora inferans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubense;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Die erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen den Erreger von Reisfleckenkrankheit (Pyricularia oryzae) einsetzen.

Dabei zeigen die erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe neben hervorragenden protektiven Eigenschaften

ten auch sehr gute systemische Wirksamkeit.

Darüber hinaus zeigen die erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe auch bakterizide Wirksamkeit.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, ferner in Formulierungen mit Brennsätzen, wie Räucherpatronen, -dosen, -spiralen u. ä., sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z. B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Chlorethylene oder Methylchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z. B. Erdölfraktionen. Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methyläthylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser; mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z. B. Aerosol-Treibgas, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid; als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z. B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate; als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z. B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z. B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyäthylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyäthylen-Fettalkohol-Ether, z. B. Alkylaryl-polyglykol-Ether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z. B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z. B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90%.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in den Formulierungen in Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen vorliegen, wie Fungiziden, Insektiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Herbiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Wuchsstoffen, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln.

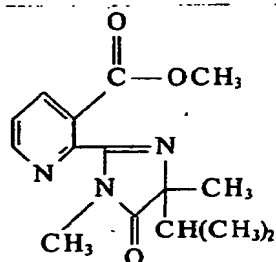
Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Pasten und Granulate, angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z. B. durch Gießen, Tauchen, Spritzen, Sprühen, Vernebeln, Verdampfen, Injizieren, Verschlänmen, Verstreichen, Stäuben, Streuen, Trockenbeizen, Feuchtbeizen, Naßbeizen, Schlammbeizen oder Inkrustieren.

Bei der Anwendung als Fungizide können die Wirkstoffkonzentrationen bei der Behandlung von Pflanzenteilen in den Anwendungsformen in einem größeren Bereich variiert werden. Sie liegen im allgemeinen zwischen 1 und 0,0001 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 0,001%.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g je Kilogramm Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 10 g, benötigt.

Bei Behandlung des Bodens sind Wirkstoffkonzentrationen von 0,00001 bis 1,0 Gew.-%, vorzugsweise 0,0001 bis 0,02 Gew.-%, am Wirkungsort erforderlich.

Beispiel 1:



Zu einer Lösung von 6 g (0,11 Mol) Natriummethylat in 300 ml Methanol gibt man 27,5 g (0,1 Mol) 2-(4-Isopropyl-4-methyl-5-oxo-imidazol-2-yl)-pyridin-3-carbonsäure-methylester, erwärmt zum Sieden und gibt dann tropfenweise 19 g (0,1 Mol) p-Toluolsulfonsäuremethylester in 75 ml Methanol zu. Nach beendeter Zugabe

erwärmt man weitere 15 Stunden auf Siedetemperatur, entfernt dann das Lösungsmittel im Vakuum, nimmt den Rückstand in Ether auf, wäscht mit Wasser, trocknet über Natriumsulfat, engt im Vakuum ein und chromatographiert über Kieselgel (Cyclohexan/Essigester/Methanol 5 : 5 : 1)

Man erhält als 2. Fraktion 18,1 g (63% der Theorie) an 2-(4-Isopropyl-1,4-dimethyl-5-oxo-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-carbonsäuremethylester als Öl.

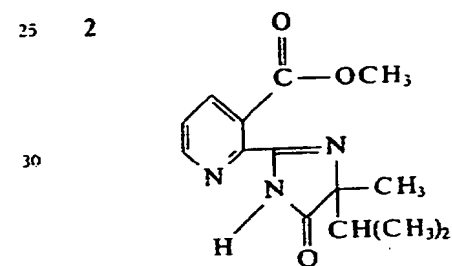
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS) $\delta = 3.0$ ppm

In entsprechender Weise und gemäß den allgemeinen Herstellungsangaben erhält man die folgenden Imidazolinyl-pyridine der Formel (I):

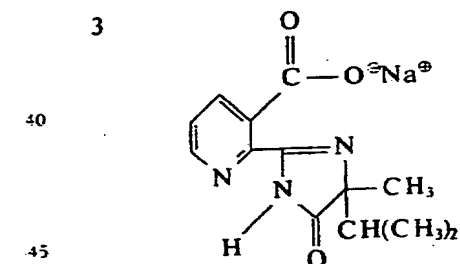


20	Beispiel Nr.	physikalische Eigenschaften
----	-----------------	--------------------------------

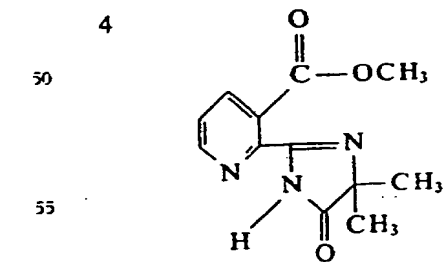
25 2 Fp. 116–118°C



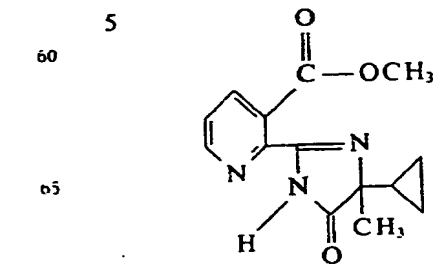
35 3 Fp. 178–185°C



45 4 Fp. 150–152°C



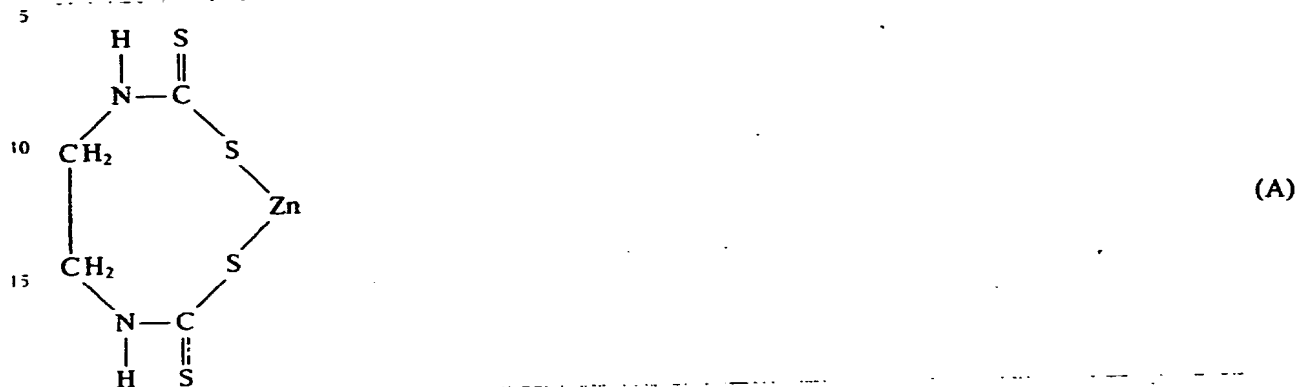
55 5 Fp. 143°C



Beispiel Nr.	physikalische Eigenschaften
6	Fp. 148°C
7	Fp. 123°C
8	Fp. 127°C
9	Fp. 91°C
10	Fp. 171°C

Anwendungsbeispiele:

In den folgenden Anwendungsbeispielen wurde die nachstehend aufgeführte Verbindung als Vergleichssubstanz eingesetzt:



Zink-ethylen-1,2-bis-(dithiocarbamat) (bekannt aus K. H. Büchel "Pflanzenschutz und Schädlingsbekämpfung" S.137, Thieme Verlag Stuttgart 1977).

Beispiel A

Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

Lösungsmittel: 12,5 Gewichtsanteile Aceton

Emulgator: 0,3 Gewichtsanteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsanteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

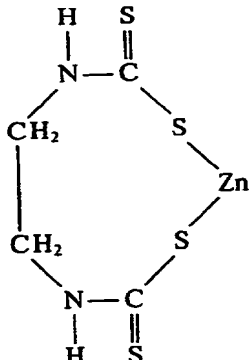
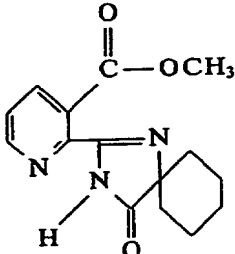
Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung bis zur Tropfnässe. Nach dem Abtrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100% rel. Luftfeuchtigkeit und 25°C aufgestellt.

4 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung des Krankheitsbefalls.

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigt in diesem Test z. B. die Verbindung gemäß folgendem Herstellungsbeispiel: 6.

Tabelle A

Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Krankheitsbefall in % der unbehandelten Kontrolle	
 (A)	0,025	75	10
(bekannt)			15
 (B)	0,025	10	20
			25
			30
			35

Beispiel B

Pyricularia-Test (Reis) / systemisch

Lösungsmittel: 12,5 Gewichtsanteile Aceton

Emulgator: 0,3 Gewichtsanteile Alkylarylpolglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

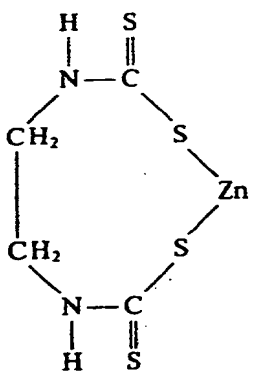
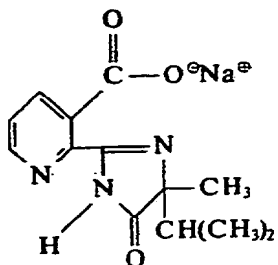
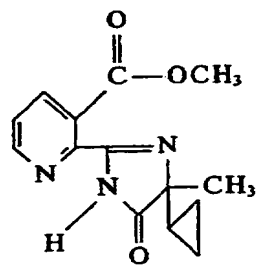
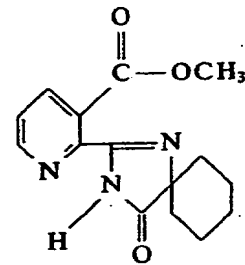
Zur Prüfung auf systemische Eigenschaften werden 40 ml der Wirkstoffzubereitung auf Einheitserde gegossen, in der junge Reispflanzen angezogen wurden. 7 Tage nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert. Danach verbleiben die Pflanzen in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von 25°C und einer rel. Luftfeuchtigkeit von 100% bis zur Auswertung.

4 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung des Krankheitsbefalls.

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z. B. die Verbindungen gemäß folgender Herstellungsbeispiele: 3, 5, und 6.

Tabelle B

Pyricularia-Test (Reis) / systemisch

Wirkstoffe		Wirkstoffkonzentra- tion in %	Krankheitsbefall in % der unbehandelten Kontrolle
 (bekannt)	(A)	100	100
 (3)	(3)	100	11
 (5)	(5)	100	10
 (6)	(6)	100	11

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

☒ BLACK BORDERS

☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

☒ FADED TEXT OR DRAWING

☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

☐ SKEWED/SLANTED IMAGES

☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

☐ GRAY SCALE DOCUMENTS

☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.